#### (12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG



(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro



# 

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 11. Dezember 2003 (11.12.2003)

#### **PCT**

# (10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 03/101414 A1

(51) Internationale Patentklassifikation?: A61K 7/48

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/05660

PCT/EP03/05660 [DE/DE];

(22) Internationales Anmeldedatum:

30. Mai 2003 (30.05.2003)

1. Juni 2002 (01.06.2002)

(25) Einreichungssprache:

102 24 387.5

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

DE

(30) Angaben zur Priorität:

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BEIERSDORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48, 20245 Hamburg (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TOM DIECK, Karen [DE/DE]; Albers-Schönberg-Stieg 11, 22307 Hamburg (DE). KOLBE, Ludger [DE/DE]; Wiesenstrasse 16, 21255 Dohren (DE). MUNDT, Claudia [DE/DE]; Holunderstr. 89a, 28207 Bremen (DE). WENSORRA, Ursula [DE/DE]; Curt-Bärweg 172, 21035 Hamburg (DE). WOLBER, Rainer [DE/DE]; Liebmannweg 11, 22399 Hamburg (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG, Unnastrasse 48, 20245 Hamburg (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): JP, US.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

#### Veröffentlicht:

mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: COSMETIC OR DERMATOLOGICAL PREPARATIONS CONTAINING LICOCHALCONE A OR AN EXTRACT OF *RADIX GLYCYRRHIZAE INFLATAE*, CONTAINING LICOCHALCONE A

(54) Bezeichnung: KOSMETISCHE ODER DERMATOLOGISCHE ZUBEREITUNGEN ENTHALTEND LICOCALCHON A ODER EINEN LICOCALCHON A ENTHALTENDEN EXTRAKT AUS RADIX GLYCYRRHIZAE INFLATAE

(57) Abstract: The invention relates to cosmetic or dermatological preparations containing an aqueous extract of Radix Glycyrrhizae inflatae or licochalcone A, at least one ethoxylated or propoxylated raw material, and optionally at least one polyol.

(57) Zusammenfassung: Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an einem wässrigen Extrakt aus Radix Glycyrrhizae inflatae oder Licochalcone A einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen gegebenenfalls einem oder mehreren Polyolen.

WO 03/101414 PCT/EP03/05660

5

#### Beschreibung

# Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend Licocalchon A oder einen Licocalchon A enthaltenden Extrakt aus Radix Glycyrrhizae inflatae

10

Die vorliegende Erfindung betrifft Wirkstoffe zur Herstellung von kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Prophylaxe und Behandlung von entzündlichen Hautzuständen und/oder zum Hautschutz bei empfindlich determinierter trockener Haut.



- 15 Ferner betrifft die Erfindung die Verwendung solcher Wirkstoffe und Zubereitungen, solche Wirkstoffe enthaltend, zur Immunstimulation der Haut, dabei vorteilhaft auch zur Immunstimulation im Sinne einer Behandlung der verletzten Haut, insbesondere zur Behandlung von Wunden.
- 20 Darüberhinaus betrifft die Erfindung Zubereitungen mit extrem niedrigem sogenanntem "Stinging Potential" sowie kosmetische oder dermatologische Formulierungen, welche die Haut z. B. nach einem Sonnenbad gezielt pflegen und die Nachreaktionen der Haut auf die Einwirkung von UV-Strahlung vermindern.
- Die Haut, insbesondere die Epidermis, ist als Barriereorgan des menschlichen Organismus in besonderem Maße äußeren Einwirkungen unterworfen. Nach dem heutigen wissenschaftlichen Verständnis repräsentiert die Haut ein immunologisches Organ, das als immunkompetentes peripheres Kompartiment eine eigene Rolle in induktiven, effektiven und regulativen Immunprozessen des Gesamtorganismus spielt.

30

Die Epidermis ist reich mit Nerven und Nervenendapparaten wie Vater-Pacini-Lamellenkörpern, Merkel-Zell-Neuritenkomplexen und freien Nervenendigungen für Schmerz-, Kälte-, Wärmeempfindung und Juckreiz ausgestattet. Immunsuppression im allgemeinen ist die Unterdrückung oder Abschwächung der Reaktivität des Immunsystems. Die Immunsuppression kann in lokale und systemische Effekte aufgegliedert werden. Letztlich umfaßt sie eine Vielzahl verschiedenster Aspekte, welche alle eine Reduktion der normalen immunologischen Abwehrmechanismen der Haut beinhalten. Es ist bekannt, das ultraviolettes (UV-) Licht, wie es im Sonnenlicht enthalten ist, zur Immunsupression führen kann. Bei Bestrahlung der Haut mit UV-Licht (insbesondere UVB-Licht) werden sowohl lokale wie auch systemische Aspekte der UV-induzierten Immunsupression beobachtet.

- Bei Menschen mit sensibler, empfindlicher oder verletzlicher Haut kann ein mit "Stinging" (<engl.> "to sting" = verletzen, brennen, schmerzen) bezeichnetes neurosensorisches Phänomen beobachtet werden. Diese "sensible Haut" unterscheidet sich grundsätzlich von "trockener Haut" mit verdickten und verhärteten Hornschichten.
- 15 Typische Reaktionen des "Stinging" bei sensibler Haut sind Rötung, Spannen und Brennen der Haut sowie Juckreiz.
  - "Stinging"-Phänomene können als kosmetisch zu behandelnde Störungen angesehen werden. Starker Juckreiz dagegen, insbesondere bei Atopie auftretendes starkes Hautjucken sowie Juckreiz bei Hauterkrankungen, kann auch als schwerwiegendere dermatologische Störung bzw. neurosensorisches Phänomen bezeichnet werden.
  - Typische, mit den Begriffen "Stinging" oder "empfindlicher Haut" in Verbindung gebrachte, störende neurosensorische Phänomene sind Hautrötung, Kribbeln, Prickeln, Spannen und Brennen der Haut und Juckreiz. Sie können durch stimulierende Umgebungsbedingungen z. B. Massage, Einwirkung (waschaktiver) Tenside, Wettereinfluß wie Sonne, Kälte, Trockenheit, aber auch feuchte Wärme, Wärmestrahlung und UV-Strahlung, z. B. der Sonne hervorgerufen werden.
- In "Journal of the Society of Cosmetic Chemists" 28, S.197 209 (Mai 1977) beschreiben P. J. Frosch und A. M. Kligman eine Methode zur Abschätzung des "Stinging-Potentials" topisch verabreichter Substanzen. Als positive Substanzen werden hier z. B. Milchsäure und Brenztraubensäure eingesetzt. Bei Messung nach dieser Methode wurden aber auch

20

5

20 -

25

Aminosäuren, insbesondere Glycin, als neurosensorisch aktiv ermittelt (solche Substanzen werden "Stinger" genannt).

Nach bisherigen Erkenntnissen tritt eine derartige Empfin lichkeit gegenüber ganz bestimmten Substanzen individuell unterschiedlich auf. Dies bedeutet, daß eine Person, die bei Kontakt mit einer Substanz "Stingingeffekte" erlebt, sie mit hoher Wahrscheinlichkeit bei jedem weiteren Kontakt wiederholt erleben wird. Der Kontakt mit anderen "Stingern" kann aber ebensogut ohne jede Reaktion verlaufen.

Viele mehr oder weniger empfindliche Personen haben auch bei Verwendung mancher desodorierenden oder antitranspirierend wirkenden Zubereitungen unter erythematösen Hauterscheinungen zu leiden.

Erythematöse Hauterscheinungen treten ferner auch als Begleiterscheinungen bei gewissen Hauterkrankungen oder -unregelmäßigkeiten auf. Beispielsweise ist der typische
Hautausschlag beim Erscheinungsbild der Akne regelmäßig mehr oder weniger stark
gerötet.

Auch die Rasur induziert in dafür empfindlichen Personen Erytheme, Brennen, Juckreiz und Spannungsgefühle, die durch die oberflächliche Verletzung und die mechanische Belastung der obersten Hautschichten sowohl bei der Nassrasur als auch bei der Trockenrasur ausgelöst werden. Diese Beschwerden treten häufig bei der täglichen Rasur der Barthaare auf, aber auch nach der Rasur von Achsel-, Scham-, und Beinbehaarung können Irritationen auftreten.

Neben den positiven Auswirkungen des Sonnenlichtes, wie dem allgemeinen Wohlbefinden, der Bildung von Vitamin D3 und der Aknebehandlung, gibt es auch negative Auswirkungen, denen es entgegenzuwirken gilt.

Die Bedingungen eines Sonnenbades stellen für den menschlichen Organismus eine ungewohnte, zum Teil extreme Belastung dar, von der insbesondere die Haut betroffen ist. Solange die Strahlenbelastung ein gewisses Ausmaß nicht überschreitet, wird unsere

- 4.

Haut damit fertig. Geringere Schäden, wie sie bei nicht spürbaren Suberythemen vorliegen, werden sofort behoben.

Setzt man die Haut allerdings zu lange der Sonne oder einer künstlichen Strahlenquelle aus, so entwickelt sich nach einer Latenzzeit von 2 bis 3 Stunden eine gegen die unbestrahlte Haut stark abgegrenzte Hautrötung, das Erythema solare. Bei dem so entstehenden Sonnenbrand unterscheidet man zwischen

- 1. Grad: Erythem (Rötung, Wärmegefühl, Brennen, Spannungsgefühl der Haut)
   klingt nach 2 bis 3 Tagen wieder ab und verschwindet unter gleichzeitig zunehmender Pigmentierung,
- 3. Grad: Zellschädigung
   es treten tiefgehende Zellschädigungen auf, der Körper reagiert mit Fieber, die
   Oberhaut wird großflächig abgestoßen.

Der 2. und 3. Grad werden auch als Dermatitis solare bezeichnet.

Die Bildung des Erythems ist abhängig von der Wellenlänge. Der Erythembereich des UV-B liegt zwischen 280 nm und 320 nm.

20

25

30

Etwa 90 % der auf die Erde gelangenden ultravioletten Strahlung besteht aus UV-A-Strahlen mit einer Wellenlänge zwischen 320 nm und 400 nm. Während die UV-B-Strahlung in Abhängigkeit von zahlreichen Faktoren stark variiert (z. B. Jahres- und Tageszeit oder Breitengrad), bleibt die UV-A-Strahlung unabhängig von jahres- und tageszeitlichen oder geographischen Faktoren Tag für Tag relativ konstant. Gleichzeitig dringt der überwiegende Teil der UV-A-Strahlung in die lebende Epidermis ein, während etwa 70 % der UV-B-Strahlen von der Hornschicht zurückgehalten werden.

Man hat lange Zeit fälschlicherweise angenommen, daß die langweilige UV-A-Strahlung nur eine vernachlässigbare biologische Wirkung aufweist und daß dementsprechend die UV-B-Strahlen für die meisten Lichtschäden an der menschlichen Haut verantwortlich seien. Inzwischen ist allerdings durch zahlreiche Studien belegt, daß UV-A-Strahlung im Hinblick auf die Auslösung photodynamischer, speziell phototoxischer Reaktionen und

- 5 -

chronischer Veränderungen der Haut weitaus gefährlicher als UV-B-Strahlung ist. Auch kann der schädigende Einfluß der UV-B-Strahlung durch UV-A-Strahlung noch verstärkt werden.

Da die Beiträge der verschiedenen Wellenlängebereiche des UV-Lichtes zu lichtbedingten Hautveränderungen nicht vollständig geklärt sind, geht man heute verstärkt davon aus, daß vorbeugender Schutz sowohl gegen UV-A- als auch gegen UV-B-Strahlen, beispielsweise durch Auftrag von Lichtschutzfiltersubstanzen in Form einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung auf die Haut, von grundsätzlicher Wichtigkeit ist.

Kosmetische oder dermatologische Mittel sollen, in dünner Schicht auf die Haut aufgetragen, diese vor den negativen Auswirkungen der Sonnenstrahlung schützen.

Ein Sonnenbad wird von den meisten Menschen als angenehm empfunden, die nachteiligen Folgen zunächst nicht beachtet. Allerdings hat sich in den letzten Jahren durchaus ein Bewußtsein über die negativen Auswirkungen einer zu intensiven Sonnenbestrahlung herausgebildet, weshalb mehr und stärker schützende Sonnenschutzmittel angewendet werden.

Der Sonnenbrand bzw. das Lichterythem sind die akuten Erscheinungsformen der Lichteinwirkung. Neben den bereits beschriebenen Wirkungen der UV-Strahlen kommt es in der Nachreaktion der Haut ferner zu einer verminderten Sebumproduktion und einem Austrocknen der Haut. Zur Behandlung der Haut dienen die sogenannten Aftersun-Präparate, deren Anwendung grundsätzlich nach jeder Sonnenexposition empfohlen wird. Dabei handelt es sich in der Regel um Emulsionen oder wäßrige Hydrogele, die neben üblichen Feuchthaltesubstanzen auch spezielle Wirkstoffe enthalten können, wie beispielsweise

- entzündungslindernde und kühlende Stoffe,
- lokal anaestesierende Stoffe und/oder
- desinfizierende Stoffe, um mögliche Hautinfektionen zu verhindern.

30

25

15

20

Eingesetzt werden z. B. aus Pflanzen gewonnene entzündungslindernde bzw. –hemmende Wirkstoffe wie Azulen und Bisabolol (Kamille), Glycyrrhizin (Süßholzwurzel), Hamamelin (Hamamelis) oder Gesamtextrakte, z. B. aus Aloe vera oder Kamille. Diese zeigen

- 6 -

bei leichteren Formen und lokal begrenzten Erythemreaktionen gewisse Erfolge. Gleiches gilt für Cremes mit einem hohen Gehalt an ätherischen Ölen oder Panthenol.

Aftersun-Präparate sind dazu bestimmt, die Haut nach dem Sonnenbad zu kühlen und ihr Feuchthaltevermögen zu verbessern, wobei die Vermittlung des Kühleffektes eine zentrale Rolle spielt. Dieser Kühleffekt wird beispielsweise durch hohe Mengen an Ethanol erzielt, welches beim Verteilen der Formulierung auf der Haut spontan verdunstet. Auch Hydrogele, O/W-Emulsionen (Lotionen) oder wäßrige Schüttelmixturen haben durch die Verdunstungskälte der wäßrigen Phase einen ausgeprägten Kühleffekt, der über eine lokale Gefäßverengung zu einer Entzündungsmilderung führt.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, den Nachteilen des Standes der Technik abzuhelfen und Wirkstoffe und Zubereitungen, solche Wirkstoffe enthaltend, zur kosmetischen und dermatologischen Behandlung und/oder Prophylaxe erythematöser, entzündlicher, allergischer oder autoimmunreaktiver Erscheinungen, insbesondere Dermatosen, aber auch des Erscheinungsbildes des "Stingings" zur Verfügung zu stellen.

Ferner sollten solche Wirkstoffe bzw. Zubereitungen, solche Wirkstoffe enthaltend, zur Verfügung gestellt werden, welche zur Immunstimulation der Haut, dabei vorteilhaft auch zur Immunstimulation im Sinne der die Wundheilung fördernden Wirkung, verwendet werden können.

Der Begriff "Entzündung" ist ein relativ weitgefaßter und alter Begriff. Schon vor der Zeitenwende führte Aulus Celsus vier der fünf Kardinalzeichen der Entzündung ein: 
rubor, tumor, calor und dolor (Rötung, Schwellung, Hitze und Schmerz). Im 2. Jahrhundert definierte Galen von Pergamon das 5. Zeichen functio laesa (eingeschränkte Funktion). Insgesamt umfaßt die Entzündungsforschung 2000 Jahre, davon 200 Jahre auf zellulärem Level und 20 Jahre auf molekularem Level. Dabei wurde immer offensichtlicher das der Begriff uneinheitlich ist.

30

10

15

20

Entzündliche Erkrankungen sind gekennzeichnet durch Infiltrate von Entzündungszellen die jedoch sehr verschieden zusammengesetzt sein können. Psoriasis, eine entzündliche Hauterkankung, ist z. B. gekennzeichnet durch ein Infiltrat an oligoklonalen T-Zellen und

- 7

polymorphkernigen Granulozyten in scharf umgrenzten entzündlichen Plaques. Die involvierte Haut des atopischen Ekzems hingegen ist gekennzeichnet durch infiltrierende T-Zellen gegen Umweltantigene und Eosinophilen Granulozyten. So vielfältig wie die entzündlichen Erscheinungsformen sind auch die Therapien mit anti-entzündlichen Substanzen.

Keinesfalls kann man davon ausgehen, das eine Substanz die bei der einen entzündlichen Erkrankung eine sehr gute Wirkung zeigt auch bei anderen Entzündungen genauso wirken wird. Deshalb wird in diesem Bereich intensiv geforscht, viele dieser meist chronischen Erkrankungen sind bis heute nicht zufriedenstellend therapierbar. Am nächsten kommen einer solchen allumfassenden Wirkung die Kortikosteroide, aber wegen der zum Teil gravierenden Nebenwirkungen kommen sie für eine kontinuierliche und längere Anwendung nicht in Frage. Für kosmetische Anwendungen sind Kortikosteroide aus diesem Grunde sogar ganz verboten, hier mussen andere Substanzen eingesetzt werden.

Hautberuhigende Kosmetika werden bei akuten Hautirritationen eingesetzt, diese sind von den oben beschriebenen (chronischen) Entzündungen abzugrenzen. Ursache für Irritationen können z. B. physikalische Reize wie UV-Strahlung oder Rasur sein. Insbesondere im Frühstadium und bei geringer Reizhöhe gibt es kein Infiltrat aus Entzündungszellen (T-Zellen, Makrophagen, Granulozyten,...), sondern die betroffenen Hautzellen (hauptsächlich Keratinozyten und Fibroblasten) produzieren selber eine Fülle von pro-entzündlichen Mediatoren. Diese Mediatoren aktivieren die Zellen, induzieren Abwehr- und Reparaturmechanismen und locken in der Folge dann Entzündungszellen an. Ziel der hautberuhigenden Wirkung von Kosmetika muß es also sein die negativen Folgen der Irritation zu verhindern, ohne die notwendigen Reparaturmechanismen zu blockieren. Die bekannten anti-entzündlichen Substanzen, die vor allem auf die infiltrierenden Zellen wirken sollen sind deshalb nur bedingt als Modellsubstanzen brauchbar.

30

5

10

15

20

25

Es war überraschend und darin liegt die Lösung dieser Aufgaben, daß die Verwendung von Licochalcon A oder in kosmetischen Zubereitungen zur Pflege und/oder Linderung von Erythemen welche durch physikalische Reizung der Haut hervorgerufen wurden.

5

10

15

20

25

30

- 8 -

den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen würde.

Vorteilhaft ist insbesondere eine erfindungsgemäße Verwendung, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,0001 bis 5 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 1 Gew.-%, ganz besonders 0,005 bis 0,15 Gew.-% Licochalcon A enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Vorteilhaft ist ferner insbesondere eine erfindungsgemäße Verwendung, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01 bis 2 Gew.-% an einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Vorteilhaft ist ferner insbesondere eine erfindungsgemäße Verwendung, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01 bis 2 Gew.-% an einem oder mehreren Polyolen enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Vorteilhaft ist ferner insbesondere eine erfindungsgemäße Verwendung, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen Licocalchon als Bestandteil von pflanzlichen Extracten, insbesondere von *Radix Glycyrrhizae inflatae*, enthalten.

Die Zubereitungen gemäß der Erfindung sind in jeglicher Hinsicht überaus befriedigende Präparate, die sich durch eine hervorragende Wirkung auszeichnen. Bei Anwendung der erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe bzw. kosmetischer oder topischer dermatologischer Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffen ist eine wirksame Behandlung, aber auch eine Prophylaxe von entzündlichen Hautzuständen - auch dem atopischen Ekzem - und/oder zum Hautschutz bei empfindlich determinierter trockener Haut möglich. Der erfindungsgemäße Wirkstoff bzw. kosmetische oder topische dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäßem Wirkstoff dient aber auch in überraschender Weise zur Beruhigung von empfindlicher oder gereizter Haut.

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I >

:9-

Es war für den Fachmann nicht vorauszusehen gewesen, daß die erfindungsgemäßen Zubereitungen

- lichtstrapazierte Haut oder
- von der Rasur strapazierte Haut besser pflegen,
- die Nachreaktionen der Haut auf die Einwirkung von UV-Strahlung besser vermindern,
  - die vom Sonnenbaden gereizte Haut besser beruhigen,
  - leichten Sonnenbrand schneller zum Abklingen bringen würden,
  - besser als feuchtigkeitsspendende Zubereitungen wirken,
- 10 einfacher zu formulieren sein,
  - besser die Hautglättung f\u00f6rdern und
  - sich durch besser Pflegewirkung auszeichen würden

als die Zubereitungen des Standes der Technik.

15

Die Erfindung ist selbstverständlich nicht auf Zubereitungen beschränkt, welche nach dem Sonnenbad angewendet werden, sondern umfaßt naturgemäß alle kosmetischen und dermatologischen Anwendungen, bei welchen eine entzündungslindernde Wirkung gewünscht oder von Vorteil sein könnte.

20

Hier sei insbesondere auch der Rasurbrand genannt, wie er nach der Rasur häufig auftritt.

Gegenstand der Erfindung ist daher ferner die Verwendung kosmetischer oder dermatologischer Formulierungen mit einem Gehalt an

- einem wäßrigen Extrakt aus Radix Glycyrrhizae inflatae
- einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen
- gegebenenfalls einem oder mehreren Polyolen,

im Rahmen der vorliegenden Offenbarung auch kollektiv "erfindungsgemäße 30 Wirkstoffkombination" genannt – zur Pflege licht- und rasurstrapazierter Haut und/oder zur Linderung oder der Nachreaktionen der Haut auf die Einwirkung von UV-Strahlung und/oder der Rasur.

and many of the first first transfer.

Die Pflanzenart Glycyrrhiza inflata gehört wie das in Europa offizinelle Süßholz Glycyrrhiza glabra der Gattung Glycyrrhiza an, die zur Pflanzenfamilie der Fabaceae (Erbsengewächse) gehört. Die Droge Radix Glycyrrhizae inflatae, d.h., die Wurzel der Pflanze, ist, beispielsweise in der fernöstlichen Medizin, gebräuchlich. Die Verwendung der Droge als Entzündungshemmer ist ebenfalls bekannt.

Ein Bestandteil des wäßrigen Auszugs aus Radix Glycyrrhizae inflatae ist das Licochalcon A, welches sich durch die folgende Strukturformel auszeichnet:

Es wird angenommen, daß diese Substanz, möglicherweise in Synergie mit den übrigen Bestandteilen des Extraktes, Anteil an der erfindungsgemäßen Wirkung besitzt.

Erfindungsgemäß sind demnach auch kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an

- 15 Licochalcon A
  - Wasser
  - einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen
  - gegebenenfalls einem oder mehreren Polyolen.
- Es ist erfindungsgemäß vorteilhaft, wenn die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01 bis 2 Gew.-% an einem wäßrigen Extrakt aus *Radix Glycyrrhizae inflatae* enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
- Es ist erfindungsgemäß vorteilhaft, wenn die kosmetischen cder dermatologischen Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I\_>

10

-11-

bis 2 Gew.-% an einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Insbesondere ist vorteilhaft, als ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffe das PPG-6

Decyltetradeceth-30 zu wählen.

Es ist erfindungsgemäß vorteilhaft, wenn die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01 bis 2 Gew.-% an einem oder mehreren Polyolen enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Insbesondere ist vorteilhaft, als Polyol das Butylenglycol zu wählen.

Ganz besonders vorteilhaft ist es, von einem wäßrigen Extrakt auszugehen, der unter der Bezeichnung Aqua Licorice Extract P-U der Firma Maruzen auszugehen, der ein wäßriges Gemisch (ca. 10 Gew.-% Wasser) aus *Radix Glycyrrhizae inflatae* (ca. 5 Gew.%, Anteil Licochalcone A im Extrakt ca. 22 %, PPG-6 Decyltetradeceth-30 (ca. 25 Gew.-%) und Butylenglycol (ca. 60 Gew.-%) darstellt.

Ferner ist es vorteilhaft, Licochalcone A in anderen Vehikelsystemen in einer Konzentration von 0,0001 bis 5 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 1 Gew.-%, ganz besonders 0,005 - 0,05 Gew.-% zu verwenden.

Es ist bevorzugt im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenn die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen einen oder mehrere Alkohole enthalten, insbesondere, wenn die Formulierungen in Form eines Aftersun-Präparats vorliegen und sich durch eine besondere Kühlwirkung auszeichnen sollen.

Die kosmetischen oder dermatologischen Formulierungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können bevorzugt neben einer oder mehrerer Ölphasen zusätzlich eine oder
mehrere Wasserphasen enthalten und beispielsweise in Form von W/O-, O/W-, W/O/Woder O/W/O-Emulsionen vorliegen. Solche Emulsionen können vorzugsweise auch eine
Mikroemulsion, eine Pickering-Emulsion oder eine sprühbare Emulsion sein.

Vorzugsweise enthalten die erfindungsgemäßen Formulierungen ferner weitere entzündungshemmende Substanzen, wie z. B. Allantoin, α-Bisabolol, Panthotensäure, Panthenol, Gelée Royal, Kamillenextrakte, Azulen oder Aloe-vera-Extrakt sowie unverseifbare Anteile des Avocado- oder Sojaöls und weitere Substanzen, die die gereizte Haut beruhigen. Weitere vorteilhafte Wirkstoffe sind Gerbstoffe, welche adstringierende, entzündungshemmende und/oder sekretionshemmende Wirkung haben.

Darüberhinaus können die erfindungsgemäßen Formulierungen auch vorteilhaft Dihydroxyaceton oder Nußextrakte enthalten sowie weitere Substanzen, welche die Bräune erhalten sollen.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Formulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und insbesondere zur Behandlung und der Pflege der Haut und/oder der Haare nach einem Sonnenbad und als Schminkprodukt in der dekorativen Kosmetik dienen. Entsprechend können die erfindungsgemäßen Formulierungen – je nach ihrem Aufbau – beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcrème, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Formulierungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden. Bevorzugt sind insbesondere solche kosmetischen und dermatologischen Formulierungen, die in der Form eines Aftersun-Hautpflegeproduktes oder eines After-shave-Produktes vorliegen.

Zur Anwendung werden die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Formulierungen in der für Kosmetika üblichen Weise, d. h. beispielsweise direkt – nach der Entnahme aus einer Flasche, Tube, einem Tiegel oder einem anderen Behältnis – oder mit Hilfe eines (getränkten) Tuches auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Getränkte Tücher finden als Gegenstände des täglichen Bedarfs breiten Einsatz in unterschiedlichsten Bereichen. Sie erlauben unter anderem effiziente und hautschonende Reinigung und Pflege besonders auch in der Abwesenheit von (fließendem) Wasser. Dabei besteht der eigentliche Gebrauchsgegenstand aus zwei Komponenten:

15

20

PCT/EP03/05660

- a) einem trockenen Tuch, welches aus Materialien wie Papier und/oder unterschiedlichsten Mischungen aus Natur- oder Kunstfasern aufgebaut ist und
- einer niederviskosen Tränkungslösung.
- 5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher auch kosmetische und dermatologische Tücher, welche mit kosmetischen oder dermatologischen Tränkungslösungen befeuchtet sind, die einen Gehalt an erfindungsgemäßer Wirkstoffkombination aufweisen.
- 10 Erfindungsgemäß bevorzugte "trockene" Tücher (gemäß a)) bestehen aus Vlies, insbesondere aus wasserstrahlverfestigten und/oder wasserstrahlgeprägten Vlies.

Derartige Vliese können Makroprägungen jeden gewünschten Musters aufweisen. Die zu treffende Auswahl richtet sich zum einen nach der aufzubringenden Tränkung und zum anderen nach dem Einsatzfeld, auf dem das spätere Tuch Verwendung finden soll.

Es hat sich als vorteilhaft herausgestellt für das Tuch, wenn dieses ein Gewicht von 35 bis 120 g/m<sup>2</sup>, vorzugsweise von 40 bis 60 g/m<sup>2</sup>, hat (gemessen bei 20 °C ± 2 °C und bei einer Feuchtigkeit der Raumluft von 65 % ± 5 % für 24 Stunden).

Die Dicke des Vlieses beträgt vorzugsweise 0,4 mm bis 2 mm, insbesondere 0,6 mm bis 0,9 mm.

Als Ausgangsmaterialien für den Vliesstoff des Tuches können generell alle organischen und anorganischen Faserstoffe auf natürlicher und synthetischer Basis verwendet werden. Beispielhaft sejen Viskose, Baumwolle, Zellulose, Jute, Hanf, Sisal, Seide, Wolle, Polypropylen, Polyester, Polyethylenterephthalat (PET), Aramid, Nylon, Polyvinylderivate, Polyurethane, Polylactid, Polyhydroxyalkanoat, Celluloseester und/oder Polyethylen sowie auch mineralische Fasern wie Glasfasern oder Kohlenstoffasern angeführt. Die vorliegende Erfindung ist aber nicht auf die genannten Materialien beschränkt, sondern es können eine Vielzahl weiterer Fasern zur Vliesbildung eingesetzt werden. Es ist insbesondere vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenn die eingesetzten Fasern nicht wasserlöslich sind.

15

20

25

In einer besonders vorteilhaften Ausführungsform des Vlieses bestehen die Fasern aus einer Mischung aus 70 % Viskose und 30 % PET.

Besonders vorteilhaft sind auch Fasern aus hochfesten Polymeren wie Polyamid, Polyester und/oder hochgerecktem Polyethylen.

Darüber hinaus können die Fasern auch eingefärbt sein, um die optische Attraktivität des Vlieses betonen und/oder erhöhen zu können. Die Fasern können zusätzlich UV-Stabilsatoren und/oder Konservierungsmittel enthalten.

Die zur Bildung des Tuches eingesetzten Fasern weisen vorzugsweise eine Wasseraufnahmerate von mehr als 60 mm/[10 min] (gemessen mit dem EDANA Test 10.1-72), insbesondere mehr als 80 mm/[10 min] auf.

Fernen weisen die zur Bildung des Tuches eingesetzten Fasern vorzugsweise ein Wasseraufnahmevermögen von mehr als 5 g/g (gemessen mit dem EDANA Test 10.1-72), insbesondere mehr als 8 g/g auf.

20 Es ist vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenn das Gewichtsverhältnis des ungetränkten Tuchs zu der Tränkungslösung aus dem Bereich von 2 : 1 bis 1 : 6 gewählt wird.

Die im Rahmen der Beschreibung der vorliegenden Erfindung genannten erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Formulierungen bzw. Zubereitungen stellen vorteilhafte Tränklösungen für kosmetische und dermatologische Tücher im Sinne der vorliegenden Erfindung dar.

Es ist vorteilhaft, wenn die erfindungsgemäßen Tränklösungen dünnflüssig, insbesondere sprühbar sind und z.B. eine Viskosität von weniger als 2000 mPa·s, insbesondere weniger als 1.500 mPa·s haben (Meßgerät: Haake Viskotester VT-02 bei 25 °C).

10

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Formulierungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, anfeuchtende und/oder feuchhaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel und/oder Silikonderivate sowie Moisturizer.

Als Moisturizer werden Stoffe oder Stoffgemische bezeichnet, welche kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen die Eigenschaft verleihen, nach dem Auftragen bzw. Verteilen auf der Hautoberfläche die Feuchtigkeitsabgabe der Hornschicht (auch transgeidermal water loss (TEWL) genannt) zu reduzieren und/oder die Hydratation der Hornschicht positiv zu beeinflussen.

15

20

Vorteilhafte Moisturizer im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise Glycerin, Milchsäure, Pyrrolidoncarbonsäure und Harnstoff. Ferner ist es insbesondere von Vorteil, polymere Moisturizer aus der Gruppe der wasserlöslichen und/oder in Wasser quellbaren und/oder mit Hilfe von Wasser gelierbaren Polysaccharide zu verwenden. Insbesondere vorteilhaft sind beispielsweise Hyaluronsäure und/oder ein fucosereiches Polysaccharid, welches in den Chemical Abstracts unter der Registraturnummer 178463-23-5 abgelegt und z. B. unter der Bezeichnung Fucogel®1000 von der Gesellschaft SOLABIA S.A. erhältlich ist.

Glycerin kann als Moisturizer im Sinne der vorliegenden Anmeldung im Bereich von 0,05-30 Gew.%, besonders bevorzugt sind 1-10%, eingesetzt werden.

Die jeweils einzusetzenden Mengen an kosmetischen oder dermatologischen Hilfs- und Trägerstoffen und Parfüm können in Abhängigkeit von der Art des jeweiligen Produktes vom Fachmann durch einfaches Ausprobieren leicht ermittelt werden.

30

Ein zusätzlicher Gehalt an Antioxidantien ist im allgemeinen bevorzugt. Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

PCT/EP03/05660

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

- Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.
- 10 Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:
  - Mineralöle, Mineralwachse
  - Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, ferner natürliche Öle wie z. B. Rizinusöl:
  - Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
  - Alkylbenzoate;

15

25

30

- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane 20 sowie Mischformen daraus.

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecyl-

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I\_>

10

15

20

. **6**3.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α-Carotin, β-Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butylund Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ-Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsaure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis μmol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α-Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), a-Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Melanine, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. y-Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Alanindiessigsäure, Flavonoide, Polyphenole, Catechine, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), sowie Koniferylbenzoat des Benzoëharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der vorgenannten Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Emulsionen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 bis 20 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

5

10

15

20

25

-- **- 18** - ...

palmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silkonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 bis 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkemöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen:

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus  $C_{12-15}$ -Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus  $C_{12-15}$ -Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus  $C_{12-15}$ -Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I\_>

- 19 -

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

10 Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Formulierungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft

Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monoethyl- oder -monoethyl- oder -monoethyl- oder -monoethyl- oder -monoethylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Xanthangummi und/oder Hydroxypropylmethylcellulose, jeweils einzeln oder in Kombination.

Es ist auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, kosmetische und dermatologische Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck zwar nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescrèmes oder Makeup-Produkten gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet. Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und – gewünschtenfalls – Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar. Günstig sind ferner kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen.

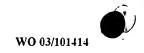
Dementsprechend enthalten die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung vorzugsweise neben dem erfindungsgemäßen Wirkstoff zusätzlich mindestens eine weitere UV-A- und/oder UV-B-Filtersubstanz. Die Formulierungen können, obgleich nicht not-

5

15

20

25



- . - 20 - "

wendig, gegebenenfalls auch ein oder mehrere organische und/oder anorganische Pigmente als UV-Filtersubstanzen enthalten, welche in der Wasser- und/oder der Ölphase vorliegen können.

Bevorzugte anorganische Pigmente sind Metalloxide und/oder andere in Wasser schwerlösliche oder unlösliche Metallverbindungen, insbesondere Oxide des Titans (TiO<sub>2</sub>), Zinks (ZnO), Eisens (z. B. Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), Zirkoniums (ZrO<sub>2</sub>), Siliciums (SiO<sub>2</sub>), Mangans (z. B. MnO), Aluminiums (Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), Cers (z. B. Ce<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), Mischoxide der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden.

10

15

20 -

25

30

Solche Pigmente können im Sinne der vorliegenden Erfindung vorteilhaft oberflächlich behandelt ("gecoatet") sein, wobei beispielsweise ein amphiphiler oder hydrophober Charakter gebildet werden bzw. erhalten bleiben soll. Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophoben Schicht versehen werden.

Erfindungsgemäß vorteilhaft sind z. B. Titandioxidpigmente, die mit Octylsilanol beschichtet sind. Geeignete Titandioxidpartikel sind unter der Handelsbezeichnung T805 bei der Firma Degussa erhältlich. Besonders vorteilhaft sind ferner mit Aluminiumstearat beschichtete TiO<sub>2</sub>-Pigmente, z. B. die unter der Handelsbezeichnung MT 100 T bei der Firma TAYCA erhältlichen.

Eine weitere vorteilhafte Beschichtung der anorganische Pigmente besteht aus Dimethylpolysiloxan (auch: Dimethicon), einem Gemisch vollmethylierter, linearer Siloxanpolymere, die endständig mit Trimethylsiloxy-Einheiten blockiert sind. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Zinkoxid-Pigmente, die auf diese Weise beschichtet werden.

Vorteilhaft ist ferner eine Beschichtung der anorganischen Pigmente mit einem Gemisch aus Dimethylpolysiloxan, insbesondere Dimethylpolysiloxan mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 350 Dimethylsiloxan-Einheiten, und Silicagel, welches auch als Simethicone bezeichnet wird. Es ist insbesondere von Vorteil, wenn die anorganischen Pigmente zusätzlich mit Aluminiumhydroxid bzw. Aluminiumoxidhydrat (auch: Alumina,

CAS-Nr.: 1333-84-2) beschichtet sind. Besonders vorteilhaft sind Titandioxide, die mit Simethicone und Alumina beschichtet sind, wobei die Beschichtung auch Wasser enthalten kann. Ein Beispiel hierfür ist das unter dem Handelsnamen Eusolex T2000 bei der Firma Merck erhältliche Titandioxid.

5

Vorteilhaftes organisches Pigment im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol) [INCI: Bisoctyltriazol], welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

10

15

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dibenzoyl20 methanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr. 70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird.

Weitere vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen sind die Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und ihre Salze, besonders die entsprechenden Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze, insbesondere das Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz mit der INCI-Bezeichnung Bisimidazylate, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Neo Heliopan AP bei Haarmann & Reimer erhältlich ist.

30

25

Ferner vorteilhaft sind das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (besonders die entprechenden 10-Sulfato-verbindungen, insbesondere das ent-

- - - 24 - ...

R<sub>2</sub> einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen, darstellt, wenn X die NH-Gruppe darstellt, und

einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-^lkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel

$$A = \begin{bmatrix} O - CH_2 - CH - \\ R_3 \end{bmatrix}_n$$

bedeutet, in welcher

10 A einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen,

R<sub>3</sub> ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,

n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,

15 wenn X ein Sauerstoffatom darstellt.

Besonders bevorzugte UV-Filtersubstanz im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner ein unsymmetrisch substituiertes s-Triazin, dessen chemische Struktur durch die Formel

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I\_>



wiedergegeben wird, welches im Folgenden auch als Dioctylbutylamidotriazon (INCI: Dioctylbutamidotriazone) bezeichnet wird und unter der Handelsbezeichnung UVASORB HEB bei Sigma 3V erhältlich ist.

Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist auch ein symmetrisch substituiertes s-Triazin, das 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoësäure-tris(2-ethylhexylester), synonym: 2,4,6-Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-1,3,5-triazin (INCI: Octyl Triazone), welches von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung UVINUL® T 150 vertrieben wird.

Auch in der Europäischen Offenlegungsschrift 775 698 werden bevorzugt einzusetzende Bis-Resorcinyltriazinderivate beschrieben, deren chemische Struktur durch die generische Formel

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_\_03101414A1\_I\_>

5

10

sprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), das auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) bezeichnet wird.

Vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner sogenannte Breitbandfilter, d.h. Filtersubstanzen, die sowohl UV-A- als auch UV-B-Strahlung absorbieren.

Vorteilhafte Breitbandfilter oder UV-B-Filtersubstanzen sind beispielsweise Bis-Resorcinyltriazinderivate. Insbesondere bevorzugt sind das 2,4-Bis-{[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (INCI: Aniso Triazin), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® S bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

Besonders vorteilhafte Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, die sich durch einen hohen bzw. sehr hohen UV-A-Schutz auszeichnen, enthalten bevorzugt mehrere UV-A- und/oder Breitbandfilter, insbesondere Dibenzoylmethanderivate [beispielsweise das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan], Benzotriazolderivate [beispielsweise das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol)], Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und/oder ihre Salze, das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und/oder dessen Salze und/oder das 2,4-Bis-{[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen miteinander.

Auch andere UV-Filtersubstanzen, welche das Strukturmotiv

$$\begin{array}{c|c}
 & R_1 & R_2 \\
 & N & N & N \\
 & N & N & N
\end{array}$$

15



aufweisen, sind vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung, beispielsweise die in der Europäischen Offenlegungsschrift EP 570 838 A1 beschriebenen s-Triazinderivate, deren chemische Struktur durch die generische Formel

- 5 wiedergegeben wird, wobei
  - R einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen, darstellt,
  - X ein Sauerstoffatom oder eine NH-Gruppe darstellt,
- einen verzweigten oder unverzweigten C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-Alkylrest, einen C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel

- 15 bedeutet, in welcher
  - A einen verzweigten oder unverzweigten  $C_1$ - $C_{18}$ -Alkylrest, einen  $C_5$ - $C_{12}$ -Cycloal-kyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren  $C_1$ - $C_4$  Alkylgruppen,
  - R<sub>3</sub> ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,
- 20 n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,





-,26 -

wiedergegeben wird, wobei  $R_1$ ,  $R_2$  und  $A_1$  verschiedenste organische Reste repräsentieren.

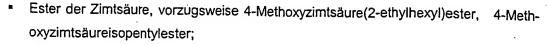
Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner das 2,4-Bis-{[4-(3-sulfonato)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin Natriumsalz, das 2,4-Bis-{[4-(3-(2-Propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-[4-(2-methoxyethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{[4-(3-(2-propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-[4-(2-ethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-{[4-(2"-methylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin und das 2,4-Bis-{[4-(1',1',1',3',5',5',5'-Heptamethylsiloxy-2"-methylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin und das 2,4-Bis-{[4-(1',1',1',3',5',5',5'-Heptamethylsiloxy-2"-methylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin.

15

10

Ein vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

- Vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner das 2-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-methyl-6-[2-methyl-3-[1,3,3,3-tetramethyl-1-[(trimethylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-phenol (CAS-Nr.: 155633-54-8) mit der INCI-Bezeichnung Drometrizole Trisiloxane.
- 25 Die UV-B- und/oder Breitband-Filter k\u00f6nnen \u00f6ll\u00f6slich oder wasserl\u00f6slich sein. Vorteilhafte \u00f6ll\u00f6sliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:
  - 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
  - 4-Aminobenzoesäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoesäure(2ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoesäureamylester;
    - 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin;
    - Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;



- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon
- 5 sowie an Polymere gebundene UV-Filter.

Vorteilhafte wasserlösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

Eine weiterere erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lichtschutzfiltersubstanz ist das Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen), welches von BASF unter der Bezeichnung Uvinul® N 539 erhältlich ist.

Es kann auch von erheblichem Vorteil sein, polymergebundene oder polymere UV-Filtersubstanzen in Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung zu verwenden, insbesondere solche, wie sie in der WO-A-92/20690 beschrieben werden.

Ferner kann es gegebenenfalls von Vorteil sein, erfindungsgemäß weitere UV-A-und/oder UV-B-Filter in kosmetische oder dermatologische Zubereitungen einzuarbeiten, beispielsweise bestimmte Salicylsäurederivate wie 4-lsopropylbenzylsalicylat, 2-Ethylhexylsalicylat (= Octylsalicylat), Homomenthylsalicylat.

Die Liste der genannten UV-Filter, die im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, ohne sie einzuschränken. Alle Mengenangaben, Anteile und Prozentanteile sind, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht und die Gesamtmenge bzw. auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen bezogen.

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_\_03101414A1\_I\_;

20





# Beispiele O/W-Crèmes

Beispiel Nr.	1	2	. 3	4	5	6
Glycerylstearatcitrat			2,00	2,00		2,00
Glycerylsterat selbstemulgierend	4,00	3,00			-	
PEG-40-Stearat	1,00					
Polyglyceryl-3-Methylglucose-Distearat					3,00	
Sorbitanstearat						2,00
Stearinsäure		1,00				
Stearylalkohol			2,00	2,00		
Cetylalkohol	3,00	2,00			3,00	
Cetylstearylalkohol		-				2,00
Lanolinalkohol			1,00	1,00		
Caprylic-/Capric-Triglycerid	5,00	3,00	4,00	4,00	3,00	3,00
Octyldodecanol				_		2,00
Dicaprylylether		4,00			2,00	1,00
Paraffinum liquidum	5,00	2,00	8,00	8,00	3,00	
Dimethicon			1,00	1,00		
Aqua Licorice Extract P-U	0,25	0,05	0,15	0,15	1,00	0,05
Tocopherol	0,1					0,20
Na₃HEDTA	0,1				0,1	
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.			q.s.	q.s.
Polyacrylsäure	3,00	0,1			0,1	0,1
Natronlauge 45%	q.s	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	5,00	3,00	7,50	7,50	3,00	3,00
Butylenglycol		3,00				
Dihydroxyaceton				1,00		
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad100	ad100	ad100	ad100	ad100	ad100

- 29 - - 30 - - 31 - - 32 - - 33 - - 34 -



#### Beispiele O/W-Crèmes

Beispiel Nr.	7	8	9	10	11
Glycerylstearatcitrat		2,00	2,00		
Glycerylsterat selbstemulgierend	5,00				
Stearinsäure			•	2,50	3,50
Stearylalkohol	2,00				
Cetylalkohol				3,00	4,50
Cetylstearylalkohol		3,00	1,00		0,50
C <sub>12-15</sub> Alkylbenzoat		2,00	3,00	•	
Caprylic-/Capric-Triglycerid	2,00				
Octyldodecanol	2,00	2,00		4,00	6,00
Paraffinum liquidum		4,00	2,00		
Cyclisches Dimethylpolysiloxan		•		0,50	2,00
Dimethicon Polydimethylsiloxan	2,00				
Titandioxid	2,00				
4-Methylbenzyliden Campher.	1,00				1,00
Butylmethoxy-dibenzoylmethan	0,50				0,50
Aqua Licorice Extract P-U	0,08	0,50	0,25	1,00	0,40
2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy-)2-hydroxyl)- phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin		1,0	3,0		0,5
Dihydroxyaceton		0,5			0,5
Tocopherol					0,05
Ethylendiamintetraessigsäure Trinatrium			0,20		0,20
Konservierungsmittel, Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gummi			0,20	·	,
Polyacrylsäure	0,15	0,1		0,05	0,05
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	3,00		3,00	5,00°	3,00
Butylenglycol	<u> </u>	3,00			
Ethanol		3,00		3,00	
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I\_>



# Beispiele W/O-Emulsionen

Beispiel Nr.	12	13	14	15	16 ·
Cetyldimethiconcopolyol		2,50		4,00	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00				4,50
PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
2-Ethylhexyl Methoxyzinnamat		8,00	_	5,00	4,00
2,4-Bis-(4-(2-ethyl-hexyloxy-)2-hydroxyl)-	2,00	2,50		2,00	2,50
phenyl)-6-(4-methoxyphenyl)-(1,3,5)-triazin	ļ				
Butylmethoxy-dibenzoylmethan			2,00	1,00	
Diethylhexyl Butamidotriazon	3,00	1,00			3,00
Ethylhexyl Triazon			3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Campher		2,00		4,00	2,00
Octocrylen	7,00	2,50	4,00		2,50
Diethylhexyl Butamidotriazon	1,00			2,00	
Phenylen-1,4-bis-(mononatrium,-2-benzimi dazyl-5,7-disulfonsäure)	1,00	2,00	0,50		
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	2,00
Titandioxid		2,00	1,50		3,00
Zinkoxid	3,00	1,00	2,00	. 0,50	
Paraffinum liquidum			10,0		8,00
C <sub>12-15</sub> Alkyl-Benzoat		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		9,00	
Dicaprylylether	10,00				7,00
Butylen-Glycol-Dicaprylat/-Dicaprat			2,00	8,00	4,00
Dicaprylylcarbonat	5,00		6,00		
Dimethicon Polydimethylsiloxan		4,00	1,00	5,00	
Phenylmethylpolysiloxan	2,00	25,00			2,00
Shea Butter			3,00		
PVP Hexadecencopolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin		0,30	1,00	٠	0,50 ·
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycinsoja		1,00	1,50		
Magnesiumsulfat	1,00	0,50		0,50	
Magnesiumchlorid			1,00		0,70
Tocopherolacetat	0,50		0,25		1,00
Aqua Licorice Extract P-U	0,15	0,08	0,5	1,00	0,80
Konservierungsmittel, Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00		1,50		1,00
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100



- 31 -

# Beispiele W/O Emulsionen

Beispiel Nr.	17 ·	18 ·
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	4,00	5,00
Lanolinalkohol	0,50	1,50
Isohexadecan	1,00	2,00
Myristyl-Myristat	0,50	1,50
Vaseline	1,00	2,00
Butylmethoxy-dibenzoylmethan	0,50	1,50
4-Methylbenzyliden Campher	1,00	3,00
Butylen-Glycol-Dicaprylat/-Dicaprat	4,00	5,00
Shea Butter	····	0,50
Butylenglycol		6,00
Octoxyglycerin	-	3,00
Glycerin	5,00	
Tocopherolacetat	0,50	. 1,00
Aqua Licorice Extract P-U	0,2	0,1
EDTA	0,20	0,20
Konservierungsmittel	, q.s.	q.s.
Ethanol	-	3,00
Parfum	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100

#### Beispiel (W/O-Creme)

Beispiel Nr.	19
Polyglyceryl-3-Diisostearat	3,50
Glycerin	3,00
Polyglyceryl-2-Dipolyhydroxystearat	3,50
Aqua Licorice Extract P-U	0,25
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Magnesiumsulfat	0,6
Isopropylstearat	2,0
Caprylylether	8,0
Cetearylisononanoat	. 6,0
Wasser	ad 100



#### Beispiel (W/O-Emulsion):

Beispiel Nr.	20
Triceteareth-4-Phosphat	0,80
Butylhydroxytoluol	0,05
Glyceryllanolat	1,70
Cyclomethicon	2,20
Isopropylpalmitat	1,00
Aqua Licorice Extract P-U	0,50
Polyacrylsäure	0,50
Ethylendiamintetraessigsäure	1,00
Natriumhydroxid	q.s.
Zitronensäure	0,01
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.ş.
Wasser	ad 100



#### Patentansprüche:

 Verwendung von Licochalcon A in kosmetischen Zubereitungen zur Pflege und/oder Linderung von Erythemen welche durch physikalische Reizung der Haut hervorgerufen 5 · wurden.

- 33 -

- 2. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,0001 bis 5 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 1 Gew.-%, ganz besonders 0,005 bis 0,15 Gew.-% Licochalcon A enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
- 3. Verwendung nach einem oder mehreren der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01 bis 2 Gew.-% an einem oder mehreren ethoxylierten oder 3 propoxylierten Rohstoffen enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
- 4. Verwendung nach einem oder mehreren der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,001 bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,05 bis 5 Gew.-%, ganz besonders 0,01 bis 2 Gew.-% an einem oder mehreren Polyolen enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
- 5. Verwendung nach einem oder mehreren der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen Licocalchon A als Bestandteil von pflanzlichen Extracten, insbesondere von Radix Glycyrrhizae inflatae, enthalten.
- 6. Verwendung nach einem oder mehreren der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen 0,0001 bis 5 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 1 Gew.-%, ganz besonders 0,005 bis 0,15 Gew.-% an einem wäßrigen Extrakt aus Radix Glycyrrhizae inflatae enthalten, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
- 30 7. Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an
  - Licochalcon A
  - einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen,
  - Wasser.
  - gegebenenfalls einem oder mehreren Polyolen.
  - 8. Verwendung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen mit einem Gehalt an
  - einem wäßrigen Extrakt aus Radix Glycyrrhizae inflatae oder Licochalcon A

BNSDOCID: <WO\_ \_03101414A1\_I\_:

10

15

20

25



- einem oder mehreren ethoxylierten oder propoxylierten Rohstoffen
- gegebenenfalls einem oder mehreren Polyolen.

zur Pflege und/oder zur Linderung von Erythemen.

- 5 9. Zubereitungen oder Verwendung nach einem der vorstehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Zubereitungen ein Gemisch aus
  - ca. 10 Gew.-% Wasser
  - ca. 5 Gew.% Radix Glycyrrhizae inflatae
  - ca. 25 Gew.-% PPG-6 Decyltetradeceth-30 und
- ca. 60 Gew.-% Butylenglycol, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht des Gemisches, enthalten.

BNSDOCID: <WO\_\_\_\_03101414A1\_I\_>



In atlonal Application No

			(CI/EI 03/	03000
A. CLASSI IPC 7	FICATION OF SUBJECT MATTER A61K7/48		-	
According to	o International Patent Classification (IPC) or to both national classificati	on and IPC		
	SEARCHED			
IPC 7	ocumentation searched (classification system followed by classification $A61K$	symbols)		
Documental	lion searched other than minimum documentation to the extent that suc	ch documents are inclu	uded in the fields se	arched
PAJ, E	ata base consulted during the International search (name of data base PO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data	and, where practical	search terms used)	
C. DOCUME	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT			
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relev	ant passages		Relevant to claim No.
Х	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2000, no. 23,		7,9	
	10 February 2001 (2001-02-10) & JP 2001 163718 A (MARUZEN PHARMALTD), 19 June 2001 (2001-06-19) abstract paragraphs '0032!,'0045!,'0046!	ACEUT CO		
x	EP 0 998 939 A (UNIV LONDON PHARMA 10 May 2000 (2000-05-10) paragraphs '0021!,'0029!,'0031!,'0036!,'0051! claims 1,2,6,9			7,9
	 -/	<b>'</b>		
X Furthe	er documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family	members are listed	in annex.
'A' document consider E' earlier do filing dat 'L' document which is citation of the me document dater tha	at defining the general state of the art which is not red to be of particular retevance cument but published on or after the International to the twhich may throw doubts on priority claim(s) or cited to establish the publication date of another or other special reason (as specified)  If referring to an oral disclosure, use, exhibition or the special reason (as specified)  It published prior to the international filing date but	citied to understan invention of document of particucannot be conside involve an invention of particucannot be conside document is combinents, such combining of the control of particucannot be considered occument is combinents, such combining of the part.	d not in conflict with d the principle or the utar relevance; the cered novel or cannot ve step when the do- utar relevance; the cered to involve an in- bined with one or mo- point of the same patent the international sea	the application but early underlying the laimed invention be considered to current is taken alone talmed invention ventive step when the re other such docu-us to a person skilled family
12	September 2003	26/09/2	003	
Name and ma	Alling address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswrijk Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni,	Authorized officer	ina. N	

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)



Instructional Application No PCT/EP 03/05660

		rci/Er US,	
C.(Continu	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages		Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 113 (C-1033), 9 March 1993 (1993-03-09) & JP 04 297418 A (SUMITOMO METAL IND LTD), 21 October 1992 (1992-10-21) abstract		7,9
Y !	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2000, no. 11, 3 January 2001 (2001-01-03) & JP 2000 212060 A (NARIS COSMETICS CO LTD), 2 August 2000 (2000-08-02) abstract paragraphs '0001!,'0003!,'0011!,'0027!,'0031!		7,9
	KOBAYASHI M. ET AL.: "Antibacterial Activity of Licochalcone A against Spore-forming Bacteria" ANTIMICROBIAL AGENTS AND CHEMOTHERAPY, vol. 46, no. 5, May 2002 (2002-05), pages 1226-1230, XP002254246 page 1226 -page 1227		7,9
	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 07, 3 July 2002 (2002-07-03) & JP 2002 080343 A (NIKKO SEIYAKU KK), 19 March 2002 (2002-03-19) abstract paragraphs '0025!,'0016!,'0026!,'0031!,'0032!		7,9

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)



International application No. EP03/05660

Box I	Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
This inte	mational search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
1. X	Claims Nos.: 1-6, 8 because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
	CT Rule 39.1(iv) – Method for treatment of the human or animal body by nerapy.
2.	Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
	±
3.	Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a)
Box II	Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)
This Inter	mational Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
	·
	·
	As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
	As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite paymen of any additional fee.
3.	As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
	·
4. [ ]	No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
Remark o	on Protest
	No protest accompanied the payment of additional search fees.

Form PCT/ISA/210 (continuation of first sheet (1)) (July 1992)



Int: Internal Application No PCT/EP 03/05660

Information on patent family members

Patent document cited in search report		Publication date :		Patent family member(s)	Publication date.
JP 2001163718	Α	19-06-2001	NONE		
EP 0998939	A	10-05-2000	EP	0998939 A1	10-05-2000
JP 04297418 8	Α		NONE		
JP 2000212060	Α	02-08-2000	NONE		
JP 2002080343	Α	19-03-2002	NONE		

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 1992)

			PCT/EP 03/	<b>/</b> 05660
A. KLASS IPK 7	SIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES A61K7/48		-	-
Nach der In	nternationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Kla	ssifikation und der IPK		
	RCHIERTE GEBIETE			
IPK 7	erter Mindestprüfstoff $$ (Klasstfikationssystem und Klassifikationssymb $$ $$ $$ $$ $$ $$ $$ $$ $$ $$	ole )		
Recherchie	erte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, s	oweit diese unter die rech	nerchierten Gebiete	fallen
	er internalionalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (7 PO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Dat		d evil. verwendete S	Suchbegriffe)
C. ALS WE	ESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN			
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angab	oe der in Betracht komme	nden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2000, no. 23, 10. Februar 2001 (2001-02-10) & JP 2001 163718 A (MARUZEN PHARN LTD), 19. Juni 2001 (2001-06-19) Zusammenfassung Absätze '0032!,'0045!,'0046!	MACEUT CO		7,9
х	EP 0 998 939 A (UNIV LONDON PHARM 10. Mai 2000 (2000-05-10) Absätze '0021!,'0029!,'0031!,'0036!,'0051 Ansprüche 1,2,6,9	·		7,9
X Weite	ere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu ehmen	X Siehe Anhang I	Patentfamilie	
Besondere  A' Veröffen aber nic  E' ålteres D Anmeld  L' Veröffent scheine anderer soll ode ausgeff  O' Veröffent eine Be  P' Veröffent dem bei Datum des Al	Kalegorien von angegebenen Veröffentlichungen: Ilichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, cht als besonders bedeutsam anzusehen ist jokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen tedatum veröffentlicht worden ist Ilichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- en zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer n in Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden er die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie	oder dem Prioritätsc Anmeldung nicht ko Erfindung zugrunde Theorie angegeben "X" Veröffentlichung von kann allein aufgrund erfinderischer Tätigl "Y" Veröffentlichung von kann nicht als auf ei werden, wenn die V	tatum veröffentlicht lildiert, sondern nur liegenden Prinzips o Ist besonderer Bedeut dieser Veröffentlich weit beruhend betrach besonderer Bedeut finderischer Tätigke eröffentlichung mit dieser Kategorie in ur einen Fachmann in Mitglied derselben internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen Reconstructuren internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen internationalen international	lung; die beanspruchte Erfindung eit beruhend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist Patentfamilie ist
	stanschriff der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Be		
	Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340–3016	Sala-Jur	ng, N	

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

PCT/EP 03/05660

Kalegorie*	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN  Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommer	nden Teile Betr. Ansprüch Nr.
	DEECH INTERNAL PROPERTY OF THE	
(	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 113 (C-1033), 9. März 1993 (1993-03-09) & JP 04 297418 A (SUMITOMO METAL IND LTD), 21. Oktober 1992 (1992-10-21) Zusammenfassung	7,9
	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2000, no. 11, 3. Januar 2001 (2001-01-03) & JP 2000 212060 A (NARIS COSMETICS CO LTD), 2. August 2000 (2000-08-02) Zusammenfassung Absätze '0001!,'0003!,'0011!,'0027!,'0031!	7,9
	KOBAYASHI M. ET AL.: "Antibacterial Activity of Licochalcone A against Spore-forming Bacteria" ANTIMICROBIAL AGENTS AND CHEMOTHERAPY, Bd. 46, Nr. 5, Mai 2002 (2002-05), Seiten 1226-1230, XP002254246 Seite 1226 -Seite 1227	7,9
	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2002, no. 07, 3. Juli 2002 (2002-07-03) & JP 2002 080343 A (NIKKO SEIYAKU KK), 19. Mārz 2002 (2002-03-19) Zusammenfassung Absātze '0025!,'0016!,'0026!,'0031!,'0032!	7,9

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzing von Blatt 2) (Juli 1992)



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)
Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:
1. $\chi$ Ansprüche Nr. $1-6$ , 8 well sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
Regel 39.1(iv) PCT – Verfahren zur therapeutischen Behandlung des menschlichen oder tierischen Körpers
2. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Telle der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. Ansprüche Nr. weil es sich dabel um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.
Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)
Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese Internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält
Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen ertaßt:
Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs  Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzung von Blatt 1 (1))(Juli 1998)

Intercionales Aklenzeichen
PCT/EP 03/05660

	Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	-
T	JP 2001163718	Α	19-06-2001	KEINE			
	EP 0998939	Α	10-05-2000	EP	0998939 A1	10-05-2000	
-	JP 04297418 8	A		KEINE			
	JP 2000212060	A	02-08-2000	KEINE			
	JP 2002080343	A	19-03-2002	KEINE			
1							

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentlamilie)(Juli 1992)